

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2002年11月7日 (07.11.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/087589 A1(51) 国際特許分類: A61K 31/549, 45/00, 31/5377, 31/55,
31/4709, A61P 31/04, 31/00, 43/00, C12Q 1/18, 1/02,
G01N 33/15 // C07D 471/04, 471/08, 417/14, 417/12

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/04087

(22) 国際出願日: 2002年4月24日 (24.04.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
09/842,234 2001年4月26日 (26.04.2001) US
特願2002-033133 2002年2月8日 (08.02.2002) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一
製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒103-8234 東京都中央区日本橋3丁目
14番10号 Tokyo (JP). エッセンシャルセラピュー
ティクスインコーポレイテッド (ESSENTIAL THER-
APEUTICS, INC.) [US/US]; 02451 マサチューセツ
州ウォルサムメインストリート 1365 MA (US).

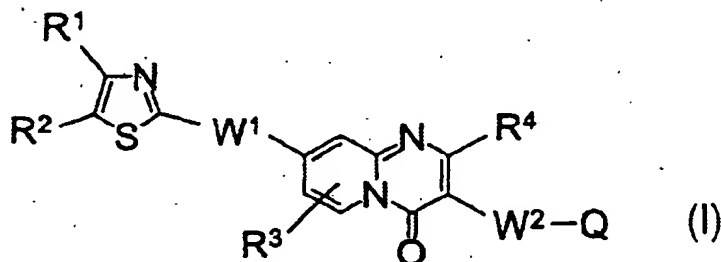
(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中山 清
(NAKAYAMA, Kiyoshi) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江戸川区北葛西1丁目16番13号 第一製薬株式
会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 大塚 雅巳
(OHTSUKA, Masami) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江
戸川区北葛西1丁目16番13号 第一製薬株式
会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 川戸 晴
子 (KAWATO, Haruko) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江
戸川区北葛西1丁目16番13号 第一製薬株式
会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 奥村 亮
(OKUMURA, Ryo) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江
戸川区北葛西1丁目16番13号 第一製薬株式
会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 星野 一樹
(HOSHINO, Kazuki) [JP/JP]; 〒134-8630 東京都江
戸川区北葛西1丁目16番13号 第一製薬株式
会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). フトキンス
ウィリアム (WATKINS, William) [GB/US]; 02451 マ
サチューセツ州ウォルサムメインストリート
1365 エッセンシャルセラピューティクスイン
コーポレイテッド内 MA (US). ツアンジェイソ
ン (ZHANG, Jason) [US/US]; 02451, マサチューセツ
州ウォルサムメインストリート 1365 エッ
センシャルセラピューティクスインコーポレイ
テッド内 MA (US). パルム モニカ (PALME, Monica)
[CA/US]; 02451 マサチューセツ州ウォルサムメイ
ンストリート 1365 エッセンシャルセラピュー
ティクスインコーポレイテッド内 MA (US). チョ
ーイソップ (CHO, Accep) [US/US]; 02451 マサチュー

[続表有]

(54) Title: MEDICINE FOR INHIBITING DRUG ELIMINATION PUMP

(54) 発明の名称: 薬剤排出ポンプ阻害薬

(57) Abstract: A medicine for prevention and/or therapy of a microbe infectious disease, which comprises, as an active component, a compound represented by the following formula (1): (1) wherein R¹ and R² each represent hydrogen, a halogen atom, a hydroxyl group or the like; W¹ represents -CH=CH-, -CH₂O-, -CH₂CH₂- or the like; R³ represents hydrogen, a halogen atom, a hydroxyl group or an amino group; R⁴ represents hydrogen, a group of -OZ_mR⁵ (where Z_m represents an alkylene group or a fluorine-substituted alkylene group or a single bond and R⁵ represents a cyclic alkyl group, an aryl group or the like) or the like; W² represents a single bond or -C(R⁶)=C(R⁷)- (where R⁶ and R⁷ each represent hydrogen, a halogen atom, a lower alkyl group or the like) and Q represents an acidic group, with the proviso that W² and Q may together form a heterocyclic ring of vinylidene thiazolidinedione or an equivalent thereof; m and n each represent an integer of 0 to 2 and q represents an integer of 0 to 3.

[続表有]



セッツ州 ウォルサム メインストリート 1365
エッセンシャル セラビューティクス インコーポレ
イテッド内 MA (US).

(74) 代理人: 特許業務法人特許事務所サイクス (SIKS &
CO.); 〒104-0031 東京都中央区京橋一丁目8番7号
京橋日殖ビル8階 Tokyo (JP).

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TO).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ,
OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

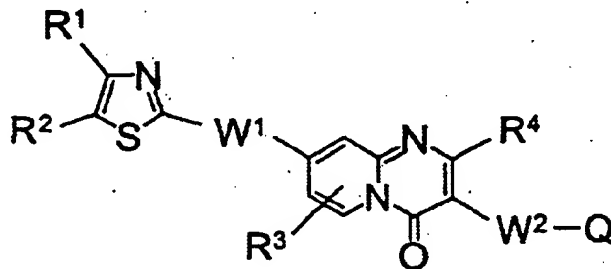
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

下記の一般式 (I) :



[R¹ 及び R² は水素、ハロゲン原子、水酸基などを示し、W¹ は -CH=CH-, -CH₂O-,
-CH₂CH₂-などを示し; R³ は水素、ハロゲン原子、水酸基、又はアミノ基を示し; R⁴
は水素、基 -OZ_mR⁵ (Z_m はアルキレン基若しくはフッ素置換アルキレン基、又は
単結合を示し、R⁵ は環状アルキル基、アリール基などを示す) などを示し; W² は
単結合又は -C(R⁶)=C(R⁷)- (R⁶ 及び R⁷ は水素、ハロゲン原子、低級アルキル基など
を示し、Q は酸性基を示すが、W² と Q とは一緒になってピニリデンチアゾリジンジ
オン又はその等価体である複素環を形成してもよく; m, n は 0 から 2 の整数を示
し、q は 0 から 3 の整数を示す) で表される化合物を有効成分として含む微生物感
染症の予防及び/又は治療のための医薬。